

⑫ 公開特許公報(A)

昭61-87695

⑬ Int. Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和61年(1986)5月6日

C 07 K 7/20
A 61 K 37/24
// C 07 K 99:54

A E E

6464-4H

7138-4C

6464-4H

審査請求 未請求 発明の数 1 (全13頁)

⑮ 発明の名称 GnRH拮抗物質

⑯ 特 願 昭60-197532

⑰ 出 願 昭60(1985)9月6日

優先権主張 ⑱ 1984年9月7日 ⑲ 米国(US) ⑳ 648637

㉑ 発 明 者 ワイリー・ウオーカ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, バ
ー・ペール・ジュニア ルデズ 1643

㉒ 発 明 者 ジャン・エドワール・ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, ブ
フレデリック・リベール ラックゴールド・ロード 9674

㉓ 出 願 人 ザ・サルク・インステ アメリカ合衆国カリフォルニア州ラ・ホーラ, ノース・ト
チユート・フオー・バレー・バインズ・ロード 10010
イオロジカル・スタデ
イーズ

㉔ 代 理 人 弁理士 湯浅 恭三 外5名

明 細 書

1. (発 明 の 名 称)

GnRH 拮抗物質

2. (特 許 請 求 の 範 囲)

(1) 次式:

$$X-R_1-(W)D-Phe-R_3-R_4-R_5-R_6(V)-R_7-Arg-Pro-R_{10}$$

[式中、Xは水素原子または7個以下の炭素原子を有するアルキル基であり;

R_1 はデヒドロ-Pro, Pro, D-pGlu, D-Phe, D-Trp または β -D-NAL であり;

WはF, Cl, Cl_2 , Br, NO_2 または $C^{\alpha}Me-Cl$ であり;

R_3 はD-Trp, (NⁱⁿFor)D-Trp または NO_2 , NH_2 , OCH_3 , F, Cl, Br または CH_3 で5位または6位が置換されたD-Trp であり;

R_4 はSer, Orn, AAL または αBu であり;

R_5 はTyr, (3F)Phe, (2F)Phe, (3I)Tyr, (3CH₃)Phe, (2CH₃)Phe, (3Cl)Phe または (2Cl)Phe であり;

R_6 はD-Lys, D-Orn または D-Dap であり;

Vは $(arg-R^1, R^2)_n(X)$ であり、ただしnは1~5であり、 R^1 および R^2 はH、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであり;

R_7 はLeu, NML, Nle または Nva であり;

そして

R_{10} はGly-NH₂, D-Ala-NH₂ または NH-Y であり、ただしYは低級アルキル、シクロアルキル、フルオル低級アルキルまたはNH-CONH-Q (ここでQはHまたは低級アルキルである) である]

で表わされるペプチドまたはその無塩性塩。

(2) R_3 が(6NO₂)D-Trp であり、 R_6 がD-Lys である特許請求の範囲第1項記載のペプチド。

(3) R_1 が β -D-2NAL である特許請求の範囲第1項または第2項記載のペプチド。

(4) VがArg₅(Ac) である特許請求の範囲第1~3項のいずれか1つに記載のペプチド。

(5) XがAc である特許請求の範囲第1~4項のいずれか1つに記載のペプチド。